

## 特許性に関する国際予備報告（特許協力条約第二章）

（法第12条、法施行規則第56条）  
〔PCT36条及びPCT規則70〕

出願人又は代理人 の書類記号 ONF-4826PCT	今後の手続きについては、様式PCT/IPEA/416を参照すること。	
国際出願番号 PCT/JP03/15718	国際出願日 (日.月.年) 09.12.2003	優先日 (日.月.年) 10.12.2002
国際特許分類 (IPC) Int.Cl <sup>7</sup> C07D213/74, 401/14, 403/04, 403/14, 471/04, 401/12, 401/04, 403/12, 405/14, 409/14, 417/14, 405/14, 409/14, 417/14, 405/12, 413/04, 413/12, 215/42, 493/04, 493/10, (補充欄その1へ続く)		
出願人 (氏名又は名称) 小野薬品工業株式会社		

1. この報告書は、PCT35条に基づきこの国際予備審査機関で作成された国際予備審査報告である。 法施行規則第57条（PCT36条）の規定に従い送付する。	
2. この国際予備審査報告は、この表紙を含めて全部で 9 ページからなる。	
3. この報告には次の附属物件も添付されている。 a <input type="checkbox"/> 附属書類は全部で _____ ページである。 <input type="checkbox"/> 補正されて、この報告の基礎とされた及び／又はこの国際予備審査機関が認めた訂正を含む明細書、請求の範囲及び／又は図面の用紙（PCT規則70.16及び実施細則第607号参照）。 <input type="checkbox"/> 第I欄4.及び補充欄に示したように、出願時における国際出願の開示の範囲を超えた補正を含むものとの国際予備審査機関が認定した差替え用紙 b <input type="checkbox"/> 電子媒体は全部で _____ (電子媒体の種類、数を示す)。 配列表に関する補充欄に示すように、コンピュータ読み取り可能な形式による配列表又は配列表に関連するテーブルを含む。(実施細則第802号参照)	
4. この国際予備審査報告は、次の内容を含む。 <input checked="" type="checkbox"/> 第I欄 国際予備審査報告の基礎 <input type="checkbox"/> 第II欄 優先権 <input checked="" type="checkbox"/> 第III欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての国際予備審査報告の不作成 <input checked="" type="checkbox"/> 第IV欄 発明の単一性の欠如 <input checked="" type="checkbox"/> 第V欄 PCT35条(2)に規定する新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解、それを裏付けるための文献及び説明 <input checked="" type="checkbox"/> 第VI欄 ある種の引用文献 <input type="checkbox"/> 第VII欄 国際出願の不備 <input checked="" type="checkbox"/> 第VIII欄 国際出願に対する意見	

国際予備審査の請求書を受理した日 11.06.2004	国際予備審査報告を作成した日 04.11.2004		
名称及びあて先 日本国特許庁 (IPEA/JP) 郵便番号100-8915 東京都千代田区霞が関三丁目4番3号	特許庁審査官 (権限のある職員) 谷尾 忍	4P	9550
電話番号 03-3581-1101 内線 3491			

## 第I欄 報告の基礎

1. この国際予備審査報告は、下記に示す場合を除くほか、国際出願の言語を基礎とした。

☐ この報告は、\_\_\_\_\_ 語による翻訳文を基礎とした。

それは、次の目的で提出された翻訳文の言語である。

- ☐ PCT規則12.3及び23.1(b)にいう国際調査  
☐ PCT規則12.4にいう国際公開  
☐ PCT規則55.2又は55.3にいう国際予備審査

2. この報告は下記の出願書類を基礎とした。(法第6条(PCT14条)の規定に基づく命令に応答するために提出された差替え用紙は、この報告において「出願時」とし、この報告に添付していない。)

☒ 出願時の国際出願書類

☐ 明細書

第 \_\_\_\_\_ ページ、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 請求の範囲

第 \_\_\_\_\_ 項、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、PCT19条の規定に基づき補正されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ 項\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 図面

第 \_\_\_\_\_ ページ/図、出願時に提出されたもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの  
 第 \_\_\_\_\_ ページ/図\*、 \_\_\_\_\_ 付で国際予備審査機関が受理したもの

☐ 配列表又は関連するテーブル

配列表に関する補充欄を参照すること。

3. ☐ 補正により、下記の書類が削除された。

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

4. ☐ この報告は、補充欄に示したように、この報告に添付されかつ以下に示した補正が出願時における開示の範囲を超えてされたものと認められるので、その補正がされなかったものとして作成した。(PCT規則70.2(c))

☐ 明細書 第 \_\_\_\_\_ ページ  
☐ 請求の範囲 第 \_\_\_\_\_ 項  
☐ 図面 第 \_\_\_\_\_ ページ/図  
☐ 配列表(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_  
☐ 配列表に関連するテーブル(具体的に記載すること) \_\_\_\_\_

\* 4. に該当する場合、その用紙に“superseded”と記入されることがある。

## 第Ⅲ欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての見解の不作成

1. 次に関して、当該請求の範囲に記載されている発明の新規性、進歩性又は産業上の利用可能性につき、次の理由により審査しない。

☐ 国際出願全体

☒ 請求の範囲 31

理由:

☒ この国際出願又は請求の範囲 31 は、国際予備審査をすることを要しない次の事項を内容としている（具体的に記載すること）。

請求の範囲 31 は、治療による人体の処置方法を含む。

☐ 明細書、請求の範囲若しくは図面（次に示す部分）又は請求の範囲 の記載が、不明確であるため、見解を示すことができない（具体的に記載すること）。

☐ 全部の請求の範囲又は請求の範囲 が、明細書による十分な裏付けを欠くため、見解を示すことができない。

☒ 請求の範囲 31 について、国際調査報告が作成されていない。

☐ ヌクレオチド又はアミノ酸の配列表が、実施細則の附属書C（塩基配列又はアミノ酸配列を含む明細書等の作成のためのガイドライン）に定める基準を、次の点で満たしていない。

書面による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

コンピュータ読み取り可能な形式による配列表が

☐

提出されていない。

☐

所定の基準を満たしていない。

☐ コンピュータ読み取り可能な形式によるヌクレオチド又はアミノ酸の配列表に関連するテーブルが、実施細則の附属書Cの2に定める技術的な要件を、次の点で満たしていない。

☐ 提出されていない。

☐ 所定の技術的な要件を満たしていない。

☐ 詳細については補充欄を参照すること。

## 第IV欄 発明の単一性の欠如

1. 請求の範囲の減縮又は追加手数料の納付の求めに対して、出願人は、

- ☐ 請求の範囲を減縮した。
- ☐ 追加手数料を納付した。
- ☐ 追加手数料の納付と共に異議を申立てた。
- ☐ 請求の範囲の減縮も、追加手数料の納付もしなかった。

2. ☒ 国際予備審査機関は、次の理由により発明の単一性の要件を満たしていないと判断したが、PCT規則68.1の規定に従い、請求の範囲の減縮及び追加手数料の納付を出願人に求めないこととした。

3. 国際予備審査機関は、PCT規則13.1、13.2及び13.3に規定する発明の単一性を次のように判断する。

- ☐ 満足する。
- ☒ 以下の理由により満足しない。

請求の範囲1に記載された化合物の一般式は、一定の基本骨格を有しておらず、全体が多数の選択枝を含む可変の基で表現されている。そして、この一般式で表される化合物が共有する構造上の特徴は、N含有複素環のN原子と直結する環構造を有するという点のみである。しかし、WO 01/040227 A1にも記載されているように、N含有複素環のN原子と直結する環構造を有する化合物は公知であり、また、この化合物がケモカイン受容体拮抗作用を有することも公知である。このように、上記構造上の特徴は、先行技術に対する貢献を考慮した際に、特別の技術的特徴となり得ず、これ以外に、請求の範囲1に記載された化合物は共通する技術的特徴を有していない。

したがって、請求の範囲1に記載された発明は、単一の発明概念を形成するように連関しているとはいえない。

請求の範囲2-30、32に記載された発明についても同様に、これらは特別の技術的特徴を共有しておらず、単一の一般的発明概念を形成するように連関している一群の発明であるとは認められない。

4. したがって、国際出願の次の部分について、この報告を作成した。

- ☐ すべての部分
- ☒ 請求の範囲 1-30, 32 に関する部分

第V欄 新規性、進歩性又は産業上の利用可能性についての法第12条(PCT35条(2))に定める見解、それを裏付ける文献及び説明

1. 見解

新規性(N)	請求の範囲	9、19-24、26、28-30	有
	請求の範囲	1-8、10-18、25、27、32	無
進歩性(I.S)	請求の範囲	9	有
	請求の範囲	1-8、10-30、32	無
産業上の利用可能性(IA)	請求の範囲	1-30、32	有
	請求の範囲		無

2. 文献及び説明(PCT規則70.7)

文献一覧

1. WO 00/56729 A1(ANORMED INC.)2000.09.28 & EP 1163238 A1
2. WO 02/22599 A2(ANORMED INC.)2002.03.21 & EP 1317451 A1
3. WO 01/40227 A1(小野薬品工業株式会社)2001.06.07 & EP 1236726 A1
4. JP 2002-348288 A(小野薬品工業株式会社)2002.12.04(ファミリーなし)
5. WO 02/45652 A2(MERCK & CO.)2002.06.13 & US 2002/137755 A1  
& EP 1341540 A2
6. Journal of Medicinal Chemistry, March 1968, Vol.11, No.2, p.392-395
7. GB 1113918 A(FARBENFABRIKEN BAYER AKTIENGESellschaft)1968.05.15  
(ファミリーなし)

<文献1、2について>

請求の範囲1-8、10-30及び32について

請求の範囲1-8、10-30及び32に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献1、2に対して新規性を有するものの、文献1、2より進歩性を有しない。

文献1、2には、CXCR4受容体の阻害作用を有する化合物、これを有効成分とするHIV感染の治療、免疫疾患及び炎症等の治療に有用な医薬が記載されており(特に、文献1の第4-5頁、第7-9頁及び第17-18頁、文献2の第6-9頁参照)、さらに、文献1には、請求項1の一般式(I)のX基である環A又は環Bの置換基として複素環又はアミノ基を選択できる旨(例えば、第12頁第18-23行、第15頁第4-7行等参照)、文献2には、請求項1の一般式(1)のX、Z基の置換基として複素環又はアミノ基を選択できる旨記載されているから(例えば、第13a頁第5-9行、第16頁第8-10行等参照)、請求の範囲1-8に記載された化合物、請求の範囲10-27に記載された医薬及び請求の範囲32に記載された化合物の製造のための使用は、文献1又は2の記載から自明である。

また、文献1、2には、ケモカイン受容体阻害剤と、逆転写酵素阻害剤あるいはプロテアーゼ阻害剤などの他のHIV治療成分とを併用することが記載されているから、請求の範囲28-30に記載された医薬も、当業者に自明である。

(補充欄その2へ続く)

## 第VI欄 ある種の引用文献

## 1. ある種の公表された文書 (PCT規則70.10)

出願番号 特許番号	公知日 (日. 月. 年)	出願日 (日. 月. 年)	優先日 (有効な優先権の主張) (日. 月. 年)
WO 03/062236 A1 EX	31. 07. 2003	10. 01. 2003	22. 01. 2002

## 2. 書面による開示以外の開示 (PCT規則70.9)

書面による開示以外の開示の種類	書面による開示以外の開示の日付 (日. 月. 年)	書面による開示以外の開示に言及している 書面の日付 (日. 月. 年)
-----------------	------------------------------	--

## 第Ⅷ欄 国際出願に対する意見

請求の範囲、明細書及び図面の明瞭性又は請求の範囲の明細書による十分な裏付についての意見を次に示す。

請求の範囲 1 に記載された化合物の一般式は、一定の基本骨格を有しておらず、全体が多数の選択肢を含む可変の基で表現され、極めて多数の化合物を含んでいる。これに対する、明細書の開示を併せて考慮しても、請求の範囲に記載された発明が、その全体にわたって有意義な先行技術文献調査が可能である程度に、PCT第5条および第6条の要件を満たしているとはいえない。

したがって、本報告書においては、明細書の記載も参考にして、請求の範囲 6 に記載された一般式で表される化合物、請求の範囲 9 に記載された化合物、及び、ケモカイン受容体阻害作用を有する窒素含有複素環化合物に限定して報告書を作成した。

## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

第 欄の続き

(補充欄その1)

(国際特許分類 (IPC) の続き)

C07D495/04, 473/16, 251/50, 239/42, A61K31/55, 31/506, 31/551, 31/4725,  
31/517, 31/553, 31/4709, 31/444, 31/519, 31/506, A61P3/00, 9/00, 25/00,  
29/00, 31/00, 31/18, 35/00, 37/00, 37/08, 43/00



## 補充欄

いずれかの欄の大きさが足りない場合

## 第 V 欄の続き

## (補充欄その2)

## &lt;文献3、4について&gt;

請求の範囲1-3、10-18、27及び32について

請求の範囲1-3、10-18、27及び32に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献3、4より新規性、進歩性を有しない。

文献3、4には、請求の範囲1-3に記載された化合物の一般式に包含される化合物が、ケモカイン受容体阻害作用を有し、HIV感染の治療や、免疫疾患等の治療に有用な医薬の有効成分として記載されている〔特に、文献3の第184-185頁、第304頁、第311-312頁、第320頁、第328頁、第336頁、第343頁、第344-345頁、第351-352頁、第359-362頁及び第378頁、並びに、文献4の第33頁の化合物2(33)、第35頁の化合物2(54)及び第36頁の化合物2(62)参照〕。

したがって、請求の範囲1-3に記載された化合物、請求の範囲10-18及び27に記載された医薬並びに請求の範囲32に記載された化合物の製造のための使用は、文献3、4に記載された発明と同一である。

## &lt;文献5-7について&gt;

請求の範囲1-8、10-18、25、27及び32について

請求の範囲1-8、10-18、25、27及び32に記載された発明は、国際調査報告で引用された文献5-7より新規性、進歩性を有しない。

文献5-7には、アゼピン-1-イル基と、置換アミノ基とを有するN含有複素環が記載されているから（特に、文献5の第105頁の化合物25-4、文献6の第393頁の化合物23、文献7の第5頁のcompound k参照）、請求の範囲1-8に記載された化合物は、文献5-7より新規性及び進歩性が否定される。

また、文献5には上記化合物が炎症疾患の治療に有用であることが記載されているから、請求の範囲10-18及び27に記載された医薬並びに請求の範囲32に記載された化合物の製造のための使用は、文献5に記載された発明と同一である。

また、文献6には、上記化合物が神経に対する作用物質であることが記載されているから、請求の範囲10-18、25及び27に記載された医薬並びに請求の範囲32に記載された化合物の製造のための使用は、文献6に記載された発明と同一である。

## &lt;文献1-7について&gt;

請求の範囲9について

請求の範囲9に記載された発明は、文献1-7に対して新規性、進歩性を有する。

請求の範囲9に記載された化合物は、文献1-7の記載から当業者に自明ではない。